

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2003 年 12 月 4 日 (04.12.2003)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 03/099813 A1(51) 国際特許分類⁷: C07D 405/14, 407/06, 407/14,
487/04, 487/08, A61K 31/336, 31/366, 31/4025, 31/4427,
31/4523, 31/454, 31/4545, 31/496, 31/5377, 31/551, A61P
9/10, 17/06, 19/02, 27/02, 29/00, 35/00, 35/02, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP03/06779

(22) 国際出願日: 2003 年 5 月 29 日 (29.05.2003)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2002-155853 2002 年 5 月 29 日 (29.05.2002) JP
特願2002-223355 2002 年 7 月 31 日 (31.07.2002) JP
特願2003-63176 2003 年 3 月 10 日 (10.03.2003) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): メルシャ
ン株式会社 (MERCIAN CORPORATION) [JP/JP]; 〒
104-8305 東京都中央区京橋一丁目5番8号 Tokyo
(JP). エーザイ株式会社 (EISAI CO., LTD.) [JP/JP]; 〒
112-8088 東京都文京区小石川4丁目6番10号
Tokyo (JP).

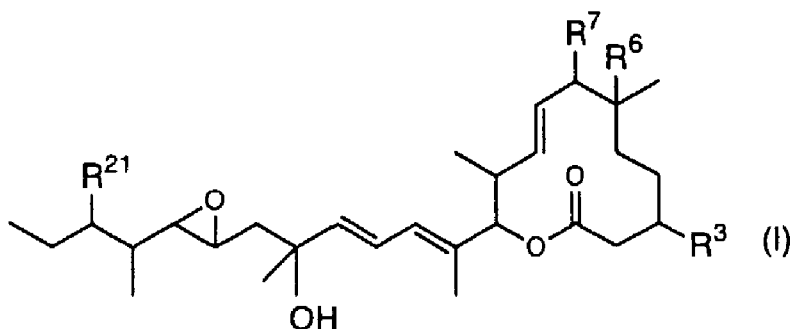
(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 小竹 良彦
(KOTAKE, Yoshihiko) [JP/JP]; 〒300-0832 茨城県土
浦市桜ヶ丘町39-13 Ibaraki (JP). 新島 淳 (NI-
IJIMA, Jun) [JP/JP]; 〒305-0035 茨城県つくば市松
代1-14-10-B202 Ibaraki (JP). 福田 吉男
(FUKUDA, Yoshio) [JP/JP]; 〒305-0035 茨城県つく
ば市松代2-25-3-403 Ibaraki (JP). 永井 光雄
(NAGAI, Mitsuo) [JP/JP]; 〒305-0035 茨城県つくば市松代5-2-35 Ibaraki (JP). カナダ レジナ ミキエ
(KANADA, Regina Mikie) [BR/JP]; 〒305-0061 茨城県
つくば市稲荷前9-7-410 Ibaraki (JP). 中島 崇
(NAKASHIMA, Takashi) [JP/JP]; 〒438-0078 静岡県磐
田市 中泉1797 ひかりハイツ332 Shizuoka (JP).
吉田 政史 (YOSHIDA, Masashi) [JP/JP]; 〒438-0078
静岡県磐田市 中泉1797 ひかりハイツ326
Shizuoka (JP). 土田 外志夫 (TSUCHIDA, Toshio)
[JP/JP]; 〒438-0077 静岡県磐田市 国府台118-1
コスモス102 Shizuoka (JP).(74) 代理人: 古谷 聡, 外 (FURUYA, Satoshi et al.); 〒103-
0007 東京都中央区日本橋浜町2-17-8 浜町花長
ビル6階 Tokyo (JP).(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,
DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI,
NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK,
SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN,
YU, ZA, ZM, ZW.(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ,
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM,
AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許
(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB,
GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),
OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,
ML, MR, NE, SN, TD, TG).添付公開書類:
— 国際調査報告書

[続葉有]

(54) Title: NOVEL PHYSIOLOGICALLY ACTIVE SUBSTANCES

(54) 発明の名称: 新規生理活性物質

(57) Abstract: Compounds represented by the following general formula (I), pharmaceutically acceptable salts thereof or hydrates of the same: (I) wherein R³, R⁶, R⁷ and R²¹ are the same or different and each represents hydroxy, etc. Because of inhibiting angiogenesis (in particular, VEGF production in hypoxia), the compounds (I) are useful as remedies for solid cancer.

[続葉有]

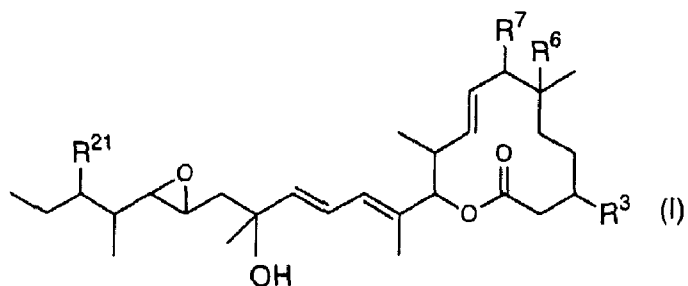
WO 03/099813 A1



2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

本発明は、式 (I)



[式中、R³、R⁶、R⁷ および R²¹ は、同一または異なって、水酸基等]で表される化合物、もしくはその薬理学上許容される塩またはそれらの水和物に関する。本発明の化合物 (I) は、血管新生を抑制し、特に低酸素状態での VEGF 産生を抑制することから、固形癌治療剤として有用である。